

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局



(43) 国際公開日  
2005 年 2 月 10 日 (10.02.2005)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2005/012284 A1

(51) 国際特許分類: C07D 333/74, 495/04, A61K 31/381, A61P 3/04, 3/06, 3/10

(74) 代理人: 佐島 宗一、外 (SATORI, Soichi et al.); 〒1708633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社 知的財産部内 Tokyo (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/010944

(22) 国際出願日: 2004 年 7 月 30 日 (30.07.2004)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願 2003-204357 2003 年 7 月 31 日 (31.07.2003) JP

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 大正製薬株式会社 (TAISHO PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 Tokyo (JP).

(72) 発明者: および

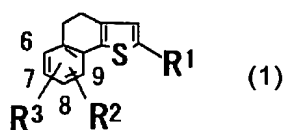
(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 田口 稔 (TAGUCHI, Minoru) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 鈴木 亮 (SUZUKI, Ryo) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP). 三上 綾子 (MIKAMI, Ayako) [JP/JP]; 〒1708633 東京都豊島区高田 3 丁目 2 4 番 1 号 大正製薬株式会社内 Tokyo (JP).

添付公開書類:  
— 国際調査報告書

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: 4,5-DIHYDRONAPHTHO[1,2-b]THIOPHENE DERIVATIVE

(54) 発明の名称: 4, 5-ジヒドロナフト [1, 2-b] チオフェン誘導体



(57) Abstract: A 4,5-dihydronaphtho[1,2-b]thiophene derivative represented by the formula (1) (wherein R<sup>1</sup> represents C<sub>1-10</sub> 1-hydroxyalkyl or C<sub>1-10</sub> acyl, and R<sup>2</sup> and R<sup>3</sup> are separately bonded in respective positions selected among the 6-, 7-, 8-, and 9-positions and each independently represents hydrogen, halogeno, C<sub>1-10</sub> alkyl, hydroxy, C<sub>1-10</sub> alkoxy, C<sub>1-5</sub> alkenyloxy, C<sub>1-5</sub> alkynyloxy, benzyloxy, etc., provided that when R<sup>1</sup> is acyl and R<sup>2</sup> is hydrogen, then R<sup>3</sup> is neither hydrogen nor acetyl) or a pharmaceutically acceptable salt of the derivative. It is a novel compound effective in reducing triglyceride amount in the liver and reducing blood sugar level.

(57) 要約: 式 (式中、R<sup>1</sup>は炭素原子数 1~10 の 1-ヒドロキシアシル基又は炭素原子数 1~10 のアシル基を示し、R<sup>2</sup>及び R<sup>3</sup>は別々に 6 位、7 位、8 位又は 9 位のいずれかに置換し、R<sup>2</sup>及び R<sup>3</sup>は独立して、水素原子、ハロゲン原子、炭素原子数 1~10 のアルキル基、水酸基、炭素原子数 1~10 のアルコキシ基、炭素原子数 1~5 のアルケニルオキシ基、炭素原子数 1~5 のアルキニルオキシ基、ベンジルオキシ基等を示す。ただし、R<sup>1</sup>がアシル基であり、R<sup>2</sup>が水素原子であるとき R<sup>3</sup>は水素原子又はアセチル基を除く。) で表される 4, 5-ジヒドロナフト [1, 2-b] チオフェン誘導体又はその医薬上許容される塩であり、肝臓中のトリグリセリド低下作用および血糖値低下作用を有する新規な化合物である。

WO 2005/012284 A1